

Rec'd PCT/PTO 28 APR 2005

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT (Artikel 36 und Regel 70 PCT)



Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054015	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12013	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 29.10.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 30.10.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07C303/34		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☒ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

 Diese Anlagen umfassen insgesamt 9 Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:
 - I ☒ Grundlage des Bescheids
 - II ☐ Priorität
 - III ☒ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
 - IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
 - V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)iii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
 - VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
 - VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
 - VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 03.05.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 02.03.2005
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Goetz, G Tel. +49 89 2399-8105 

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

Beschreibung, Seiten

1-68 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-21 eingegangen am 04.10.2004 mit Schreiben vom 01.10.2004

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☒ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

siehe Beiblatt

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

III. Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

1. Folgende Teile der Anmeldung wurden nicht daraufhin geprüft, ob die beanspruchte Erfindung als neu, auf erfinderischer Tätigkeit beruhend (nicht offensichtlich) und gewerblich anwendbar anzusehen ist:

☐ die gesamte internationale Anmeldung,

☒ Ansprüche Nr. 18-21

Begründung:

☐ Die gesamte internationale Anmeldung, bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. beziehen sich auf den nachstehenden Gegenstand, für den keine internationale vorläufige Prüfung durchgeführt werden braucht (*genaue Angaben*):

☐ Die Beschreibung, die Ansprüche oder die Zeichnungen (*machen Sie bitte nachstehend genaue Angaben*) oder die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unklar, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*):

☐ Die Ansprüche bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unzureichend durch die Beschreibung gestützt, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte.

☐ Für die obengenannten Ansprüche Nr. wurde kein internationaler Recherchenbericht erstellt.

2. Eine sinnvolle internationale vorläufige Prüfung kann nicht durchgeführt werden, weil das Protokoll der Nukleotid- und/oder Aminosäuresequenzen nicht dem in Anlage C der Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard entspricht:

☐ Die schriftliche Form wurde nicht eingereicht bzw. entspricht nicht dem Standard.

☐ Die computerlesbare Form wurde nicht eingereicht bzw. entspricht nicht dem Standard.

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)

Ja: Ansprüche 1-17

Nein: Ansprüche

Erfinderische Tätigkeit (IS)

Ja: Ansprüche 1-17

Nein: Ansprüche

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)

Ja: Ansprüche: 1-17

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

- D1: WO 01 83459 A (BASF AG) 8. November 2001 (2001-11-08) in der Anmeldung erwähnt
- D2: DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BODRIKOV, I. V. ET AL: 'Adducts of nitriles with sulfur trioxide and their reactions' retrieved from STN Database accession no. 84:59407 CA XP002270931 & ZHURNAL ORGANICHESKOI KHIMII (1975), 11(10), 2217 ,
- D3: DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] Beilstein Institut zur Förderung der Chemischen Wissenschaften, Frankfurt am Main, DE; retrieved from XFIRE Database accession no. bm 2309607 XP002270932 & J ORG CHEM USSR, Bd. 13, 1977, Seiten 390-394,

1. Die mit Schreiben vom 01.10.04 eingereichten Änderungen bringen Sachverhalte ein, die im Widerspruch zu Artikel 34(2)(b) PCT über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgehen. Es handelt sich dabei um die Ansprüche 18 bis 21.

Die nunmehr beanspruchten Verbindungen der Formel (II) (Anspruch 18) und (V) (Anspruch 19) stellen eine neu gebildete Gruppe von Verbindungen dar, welche aus einer Auswahl von mehreren Listen von Variablen entstanden ist. Eine derartige Auswahl muss als eine neue Gruppe von Verbindungen angesehen werden, welche in der ursprünglich eingereichten Anmeldung nicht offenbart ist.

Insbesondere sind die in den Ansprüchen 18 und 19 beanspruchten Verbindungen nicht auf den Seiten 10 bis 12 als offenbart anzusehen, sondern müssen als eine neu entstandene Auswahl von Verbindungen betrachtet werden.

Damit geht der Gegenstand der Ansprüche 18 und 19 sowie der Ansprüche 20 und 21 über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinaus.

Eine Prüfung dieser Ansprüche kann somit nicht durchgeführt werden.

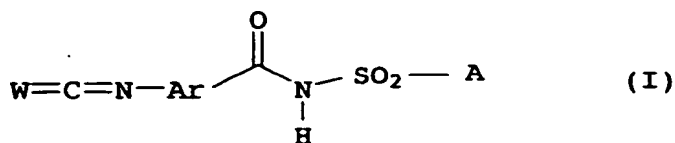
2. Die Ansprüche 1 bis 10 sowie 15 bis 17 beanspruchen ein Verfahren zur Herstellung

von Phenyliso(thio)cyanaten, welche in den Ansprüchen 11 bis 14 beansprucht werden. Diese Produkte dienen als Ausgangsstoffe zur Herstellung von Pflanzenschutzmitteln.

3. In keinem der zur Verfügung stehenden Dokumente werden derartige Verbindungen beschrieben. Insbesondere D1, welches als der nächstliegende Stand der Technik anzusehen ist, offenbart lediglich die entsprechenden Nitro- bzw. Amin-Derivate, nicht jedoch die Phenyliso(thio)cyanate.
Damit ist der Gegenstand der Ansprüche 11 bis 14 sowie 1 bis 10 und 15 bis 17 als neu gegenüber besagtem Stand der Technik zu betrachten (PCT Artikel 33.2).
4. Im Hinblick auf D1 ist die zugrunde liegende Aufgabe in der Bereitstellung von Phenyliso(thio)cyanaten zu sehen, welche als Ausgangsstoffe zur Herstellung von Pflanzenschutzmitteln dienen können.
Die vorgeschlagene Lösung ist in der Bereitstellung von Phenyliso(thio)cyanaten gemäß der Formel (I) und (Ia) gemäß der Ansprüche 11 bis 14 zu sehen.
Diese Lösung wird anhand des vorliegenden Standes der Technik nicht nahe gelegt. Insbesondere scheint gemäß der Ausführungen auf Seite 2 der Beschreibung aufgrund der Anwesenheit einer weiteren reaktiven Gruppe (Sulfonamid-gruppe) die Herstellung derartiger Phenyliso(thio)cyanate nicht möglich zu sein.
Damit basiert der Gegenstand der Ansprüche 11 bis 14 und damit auch der Ansprüche 1 bis 10 und 15 bis 17 auf einer erfinderischen Tätigkeit (PCT Artikel 33.3).
5. Die gewerbliche Anwendbarkeit wird für alle Ansprüche 1 bis 17 anerkannt (PCT Artikel 33.4.)

Patentansprüche

1. Verfahren zur Herstellung von Phenyliso(thio)cyanaten der
allgemeinen Formel I,



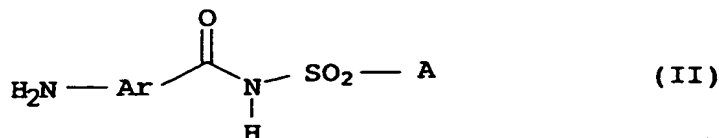
worin die Variablen folgende Bedeutung haben:

W Sauerstoff oder Schwefel,

Ar Phenyl, das durch folgende Gruppen ein- oder mehrfach
substituiert sein kann: Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Halo-
genalkyl oder Cyano,

A ein von einem primären oder sekundären Amin abgeleiteter
Rest oder NH₂,

dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der allge-
meinen Formel II,

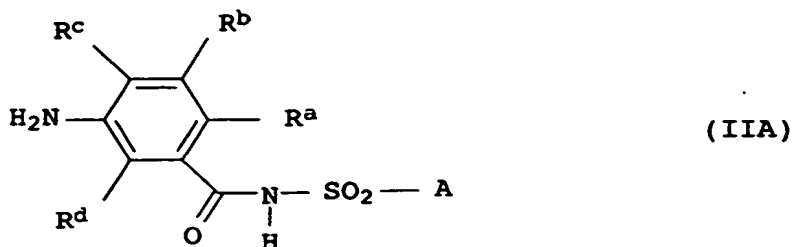


worin die Variablen Ar und A die zuvor genannten Bedeutungen
aufweisen, oder deren HCl-Addukt mit Phosgen, Thiophosgen
oder Diphosgen umgesetzt.

2. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man
das HCl-Addukt der Verbindung II einsetzt.
3. Verfahren nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet,
dass man 0,9 bis 2 Moläquivalente Phosgen, Thiophosgen oder
Diphosgen bezogen auf die Verbindung II einsetzt.
4. Verfahren nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch ge-
kennzeichnet, dass man die Umsetzung des Chlorwasserstoffad-
duktes der Verbindung II in Gegenwart von Aktivkohle durch-
führt.

5. Verfahren nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel IIA,

5



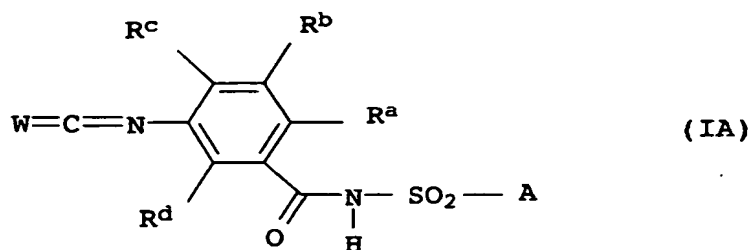
10

worin

- 15 R^a , R^b , R^c und R^d unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Halogenalkyl oder Cyano stehen und
A die zuvor genannte Bedeutung aufweist,

oder deren HCl-Addukt mit Phosgen, Thiophosgen oder Diphosgen umgesetzt, wobei man eine Verbindung der Formel IA,

20



25

- 30 worin die Variablen R^a , R^b , R^c , R^d , A und W die zuvorgenannten Bedeutungen aufweisen, erhält.

6. Verfahren nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, dass der Rest A in Formel I für $-NR^1R^2$ steht, worin die Variablen R^1 und R^2 die folgenden Bedeutungen aufweisen:

35

R^1 und R^2 stehen unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_{10} -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl oder C_2 - C_{10} -Alkinyl, die unsubstituiert oder durch einen der folgenden Reste substituiert sein können: C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, CN, NO_2 , Formyl, C_1 - C_4 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -Alkylaminocarbonyl, C_1 - C_4 -Dialkylaminocarbonyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_3 - C_{10} -Cycloalkyl, 3- bis 8-gliedriges Heterocyclyl mit ein, zwei oder

45

drei unter O, S, N und einer Gruppe NR^6 (worin R^6 für

71

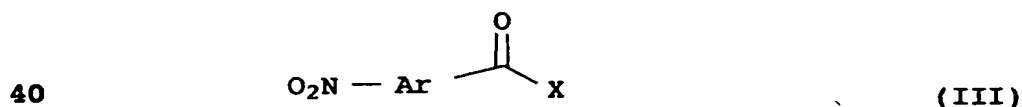
Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkyl
 nyl steht) ausgewählten Heteroatomen, Phenyl, das seiner-
 seits 1, 2, 3 oder 4 Substituenten, ausgewählt unter Ha-
 logen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Fluoralkyl, C₁-C₄-
 5 Alkyloxycarbonyl, Trifluormethylsulfonyl, C₁-C₃-Alkyl-
 amino, C₁-C₃-Dialkylamino, Formyl, Nitro oder Cyano, auf-
 weisen kann,

C₁-C₁₀-Halogenalkyl, C₂-C₁₀-Halogenalkenyl, C₂-C₁₀-Halogen-
 10 alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, 3- bis
 8-gliedriges Heterocyclyl mit ein bis drei Heteroatomen,
 ausgewählt unter O, S, N und einer Gruppe NR⁶ (worin R⁶
 für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Al-
 kynyl steht), Phenyl oder Naphthyl, wobei C₃-C₈-Cycloal-
 15 kyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, 3- bis 8-gliedriges Heterocy-
 clyl, Phenyl oder Naphthyl, ihrerseits 1, 2, 3 oder 4
 Substituenten, ausgewählt unter Halogen, C₁-C₄-Alkyl,
 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Fluoralkyl, C₁-C₄-Alkyloxycarbonyl,
 Trifluormethylsulfonyl, Formyl, C₁-C₃-Alkylamino,
 20 C₁-C₃-Dialkylamino, Phenoxy, Nitro oder Cyano, aufweisen
 können, oder

R¹ und R² bilden gemeinsam einen gesättigten oder teilweise
 ungesättigten 5- bis 8-gliedrigen Stickstoffheterocyclus,
 25 der seinerseits durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy und/oder
 C₁-C₄-Halogenalkyl, substituiert sein kann, ein oder zwei
 Carbonylgruppen, Thiocarbonylgruppen und/oder ein oder
 zwei weitere Heteroatome, ausgewählt unter O, S, N und
 einer Gruppe NR⁶ (worin R⁶ die zuvor genannten Bedeutun-
 30 gen aufweist), als Ringglieder aufweisen kann.

7. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass das
 Verfahren zusätzlich die folgenden Schritte umfasst:

i) Umsetzung einer Aroylverbindung der allgemeinen Formel
 35 III,



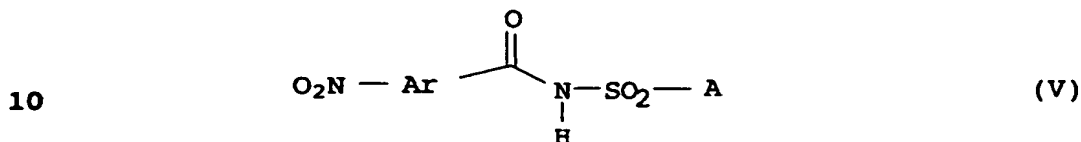
worin die Variable Ar die zuvorgenannten Bedeutungen auf-
 weist und X für Halogen, OH oder C₁-C₄-Alkoxy steht, mit
 45 einem Sulfamidsäureamid der Formel IV

72

 $\text{H}_2\text{N}-\text{SO}_2-\text{A}$ (IV),

worin A die zuvor genannten Bedeutungen aufweist und

- 5 ii) Reduktion des in Schritt i) erhaltenen N-Aroylsulfamidsäureamid der allgemeinen Formel V,



worin Ar und A die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen, wobei man eine Verbindung der Formel II erhält.

15

8. Verfahren nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass in Schritt (ii) die Reduktion in Gegenwart katalytischer Mengen an Übergangsmetallen oder Übergangsmetallverbindungen erfolgt.

20

9. Verfahren nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass in Schritt (ii) die Reduktion in Gegenwart von Eisen und wenigstens einer C_1 - C_4 -Carbonsäure erfolgt.

25

10. Verfahren nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass in Schritt (ii) die Reduktion in Gegenwart von Raney-Nickel und Wasserstoff erfolgt.

30

11. Phenyliso(thio)cyanate der allgemeinen Formel I wie in Anspruch 1 definiert.

35

12. Phenyliso(thio)cyanate der allgemeinen Formel IA wie in Anspruch 5 definiert, dadurch gekennzeichnet, dass R^a für Fluor, Chlor oder Cyano steht, R^c für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht und R^b und R^d jeweils für Wasserstoff stehen.

40

13. Phenyliso(thio)cyanate der allgemeinen Formel IA wie in Anspruch 5 definiert, dadurch gekennzeichnet, dass A für einen Rest der Formel NR^1R^2 steht, worin R^1 und R^2 die in Anspruch 6 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

45

14. Phenyliso(thio)cyanate der allgemeinen Formel IA nach Anspruch 12, dadurch gekennzeichnet, dass R^1 und R^2 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, das gegebenenfalls durch einen Substituenten ausgewählt unter Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_3 - C_8 -Cyloalkyl, Furyl, Thienyl, 1,3-Dioxolanyl, Phenyl, das seiner-

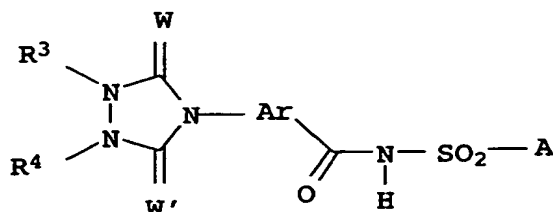
seits gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist, substituiert ist,

5 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl oder Phenyl, das gegebenenfalls durch 1 oder 2 Substituenten, ausgewählt unter Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Fluoralkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Nitro oder C₁-C₃-Dialkylamino substituiert ist, Naphththyl oder Pyridyl stehen oder

10 R¹ und R² zusammen einen fünf-, sechs- oder siebengliedrigen gesättigten oder ungesättigten Stickstoffheterocyclus, der gegebenenfalls ein weiteres Heteroatom, ausgewählt unter N, einer Gruppe NR⁶ (worin R⁶ die zuvor genannten Bedeutungen aufweist) und O, als Ringglied enthalten kann, bilden und/
15 oder durch ein, zwei oder drei Substituenten, ausgewählt unter C₁-C₄-Alkyl und C₁-C₄-Halogenalkyl, substituiert sein kann.

15. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel VI,

20



25

(VI)

worin W, Ar und A die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen aufweisen, W' für O oder S steht und R³ und R⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Cyano, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, Benzyl, OR⁵ (worin R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₃-C₇-Cycloalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder gegebenenfalls substituiertes Benzyl steht), C₁-C₃-Cyanoalkyl, stehen, oder R³ und R⁴ zusammen mit den Stickstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen vier- bis siebengliedrigen, gegebenenfalls durch Schwefel, Sauerstoff, eine Gruppe NR⁶ (worin R⁶ die zuvor genannten Bedeutungen aufweist) oder Stickstoff unterbrochenen Heterocyclus, der gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituiert ist, bilden,

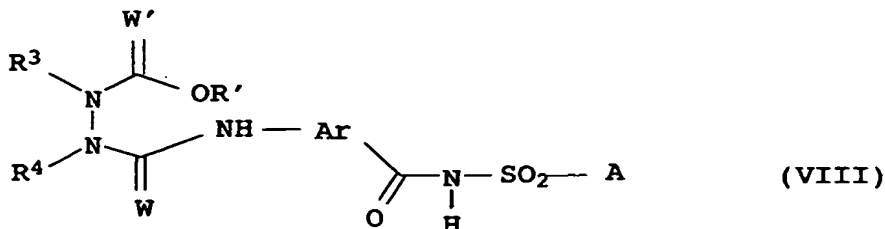
dadurch gekennzeichnet, dass man

45 (i) eine Verbindung der Formel I wie in Anspruch 1 definiert, mit einem Oxadiazincarbonsäureester der Formel VII,

74



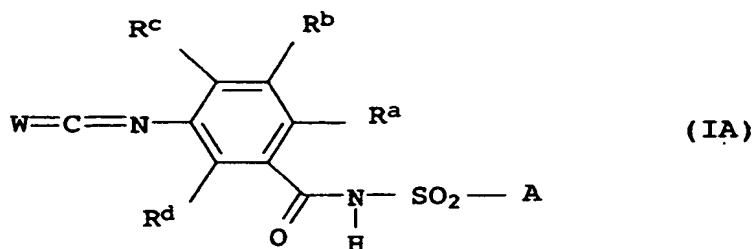
worin W' die zuvor genannte Bedeutung aufweist und R' für C₁-C₄-Alkyl steht, umgesetzt, wobei man ein Harnstoffderivat der Formel VIII erhält,



worin die Variablen R³, R⁴, R', W, W', Ar und A die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen, erhält und

(ii) das erhaltene Zwischenprodukt VIII cyclisiert, wobei man eine Verbindung der Formel VI erhält.

16. Verfahren nach Anspruch 15, dadurch gekennzeichnet, dass die in Schritt (i) eingesetzte Verbindung der Formel I für eine Verbindung der Formel IA



worin die Variablen R^a, R^b, R^c, R^d, A und W die zuvorgenannten Bedeutungen aufweisen, steht.

17. Verfahren nach Anspruch 15, dadurch gekennzeichnet, dass die in Schritt (i) eingesetzte Verbindung VII für eine Verbindung der Formel VII' steht,

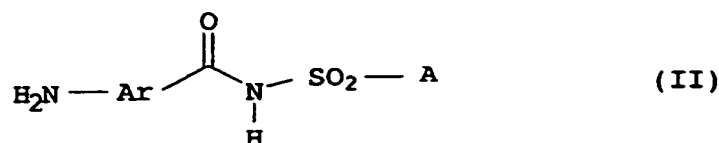


75

worin W' für O oder S und R' für C₁-C₄-Alkyl stehen.

18. Aminobenzoylsulfamidsäureamide der Formel II

5

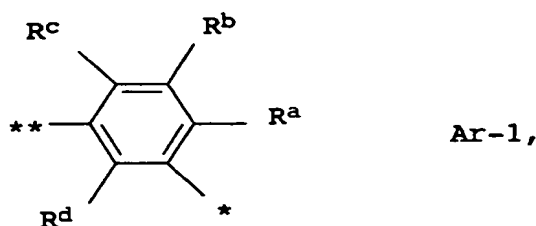


10

wobei die Variablen folgende Bedeutung haben:

Ar eine Gruppe der Formel Ar-1

15



20

worin R^a Halogen oder Cyano,

R^b Wasserstoff,

R^c Halogen oder Wasserstoff,

R^d Wasserstoff

25

bedeuten;

* die Verbindung von Ar mit der C(O)-Gruppe, und

** die Verknüpfung von Ar mit dem Stickstoffatom der Aminogruppe kennzeichnet;

30

A eine Gruppe der Formel NR¹R²,

worin einer der Reste R¹ oder R² für Wasserstoff,

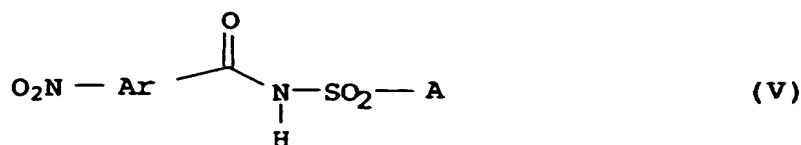
C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkynyl, und

der andere Rest R¹ oder R² für C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl oder Phenyl steht.

35

19. Nitrobenzoylsulfamidsäureamide der Formel V

40



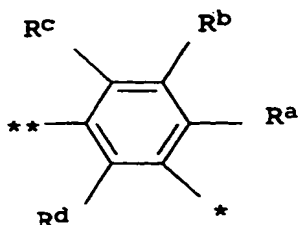
45

wobei die Variablen folgende Bedeutung haben:

76

Ar eine Gruppe der Formel Ar-1

5



Ar-1,

10

worin R^a Halogen oder Cyano,
 R^b Wasserstoff,
 R^c Halogen oder Wasserstoff,
 R^d Wasserstoff
bedeuten;

15

* die Verbindung von Ar mit der C(O)-Gruppe, und
** die Verknüpfung von Ar mit dem Stickstoffatom
der Aminogruppe kennzeichnet;

20

A eine Gruppe der Formel NR^1R^2 ,
worin einer der Reste R^1 oder R^2 für Wasserstoff,
 C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl oder C_2-C_6 -Alkynyl, und
der andere Rest R^1 oder R^2 für C_1-C_6 -Alkyl, C_3-C_8 -Cycloal-
kyl oder Phenyl steht.

25

20. Verfahren zur Herstellung von Aminobenzoylsulfamidsäureamiden
der Formel II gemäß Anspruch 18, dadurch gekennzeichnet dass
das Verfahren folgende Schritte umfasst:

30

a) Umsetzen einer Aroylverbindung der Formel III



(III)

35

wobei Ar die in Anspruch 19 genannten Bedeutungen hat und
X für Halogen oder C_1-C_4 -Alkoxy steht,

mit einem Sulfamidsäureamid der Formel IV

40

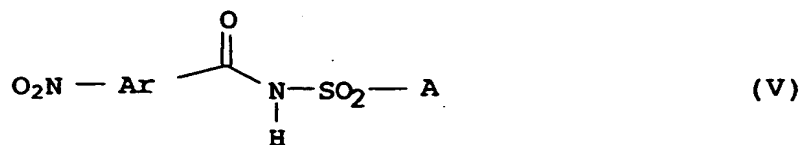


wobei A die in Anspruch 19 genannte Bedeutung hat; und

45

b) das in Stufe a) erhaltene Nitrobenzoylsulfamidsäureamid
der Formel V

77



wobei Ar und A die in Anspruch 19 genannte Bedeutung haben,

10 zum Aminobenzoylsulfamidsäureamid der Formel II gemäß Anspruch 18 reduziert.

21. Verfahren nach Anspruch 20, dadurch gekennzeichnet, dass in
Schritt b) die Reduktion in Gegenwart katalytischer Mengen an
15 Übergangsmetallen oder Übergangsmetallverbindungen erfolgt.

20

25

30

35

40

45

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2003/012013



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference M/43288-PCT	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP2003/012013	International filing date (<i>day/month/year</i>) 29 October 2003 (29.10.2003)	Priority date (<i>day/month/year</i>) 30 October 2002 (30.10.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07C 303/34		
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of <u>6</u> sheets, including this cover sheet. <input checked="" type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT). These annexes consist of a total of <u>9</u> sheets.
3. This report contains indications relating to the following items: I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report II <input type="checkbox"/> Priority III <input checked="" type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability IV <input type="checkbox"/> Lack of unity of invention V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement VI <input type="checkbox"/> Certain documents cited VII <input type="checkbox"/> Certain defects in the international application VIII <input type="checkbox"/> Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 03 May 2004 (03.05.2004)	Date of completion of this report 02 March 2005 (02.03.2005)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP2003/012013

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☐ the international application as originally filed
- ☒ the description:
 pages 1-68, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☒ the claims:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
 pages _____, filed with the demand
 pages 1-21, filed with the letter of 04 October 2004 (04.10.2004)
- ☐ the drawings:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☒ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP2003/012013

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claims Nos. 18-21

because:

☐ the said international application, or the said claims Nos. _____
relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. _____
are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. _____ are so inadequately supported
by the description that no meaningful opinion could be formed.

☐ no international search report has been established for said claims Nos. _____

2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:

☐ the written form has not been furnished or does not comply with the standard.

☐ the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 03/12013**V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement****1. Statement**

Novelty (N)	Claims	1-17	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-17	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-17	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

D1: WO 01 83459 A (BASF AG) 8 November 2001 (2001-11-08), mentioned in the application

D2: DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BODRIKOV I.V. ET AL.: 'Adducts of nitriles with sulfur trioxide and their reactions' retrieved from STN Database accession no. 84:59407 CA XP002270931 & ZHURNAL ORGANICHESKOI KHIMII (1975), 11(10), 2217

D3: DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN [Online] Beilstein Institut zur Förderung der Chemischen Wissenschaften, Frankfurt am Main, DE; retrieved from XFIRE database accession no. brn 2309607 XP002270932 & J ORG CHEM USSR, Vol. 13, 1977, pages 390-394

1. The amendments submitted with the letter of 1 January 2004 introduce substantive matter which, contrary to PCT Article 34(2)(b), goes beyond the disclosure of the international application as filed. The claims in question are claims 18 to 21. The compounds of formula (II) (claim 18) and (V) (claim 19) now claimed constitute a newly formed group of compounds which consists of a selection

from a plurality of lists of variables. Such a selection must be considered a new group of compounds, which is not disclosed in the originally filed application.

The compounds claimed in claims 18 and 19 cannot be considered to be disclosed on pages 10 to 12, but must be viewed as a new selection of compounds.

The subject matter of claims 18 and 19 and that of claims 20 and 21 goes beyond the disclosure of the international application as filed.

These claims cannot therefore be examined.

2. Claims 1 to 10 and 15 to 17 claim a method for producing phenyliso(thio)cyanates which are claimed in claims 11 to 14. These products are starting substances for producing plant protection agents.
3. None of the available documents describes such compounds. In particular D1, which can be considered the closest prior art, merely discloses the corresponding nitro- and amine derivatives, but not the phenyliso(thio)cyanates.
The subject matter of claims 11 to 14 and 1 to 10 and 15 to 17 can be considered novel over said prior art (PCT Article 33(2)).
4. With respect to D1, the basic problem can be considered the provision of phenyliso(thio)cyanates which can serve as starting substances for producing plant protection agents.
The proposed solution can be seen as the provision of phenyliso(thio)cyanates as per formulas (I) and (Ia) as per claims 11 to 14.
This solution is not suggested by the available

prior art. In particular, as per the comments made on page 2 of the description, owing to the absence of a further reactive group (sulfonamide group), the production of such phenyliso(thio)cyanates does not appear possible.

The subject matter of claims 11 to 14 and that of claims 1 to 10 and 15 to 17 thus involves an inventive step (PCT Article 33(3)).

5. Industrial applicability is acknowledged for all of claims 1 to 17 (PCT Article 33(4)).

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☒ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.